



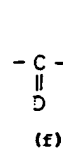
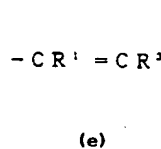
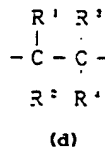
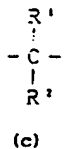
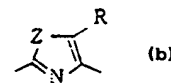
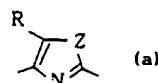
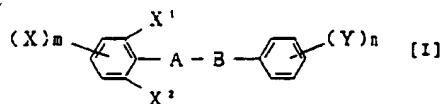
特許協力条約に基づいて公開された国際出願

<p>(51) 国際特許分類 5 C07D 263/32, 263/34, 277/22 C07D 277/24, 413/06, 417/10 A01N 43/76, 43/78</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO 94/08982  (43) 国際公開日 1994年4月28日 (28.04.1994)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP93/01459 (22) 国際出願日 1993年10月12日 (12. 10. 93)  (30) 優先権データ 特願平 4/299094 1992年10月13日 (13. 10. 92) JP 特願平 4/357334 1992年12月24日 (24. 12. 92) JP 特願平 5/123549 1993年4月27日 (27. 04. 93) JP 特願平 5/158178 1993年6月4日 (04. 06. 93) JP  (71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 日本曹達株式会社 (NIPPON SODA CO., LTD.) [JP/JP] 〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 Tokyo, (JP) (72) 発明者; および (75) 発明者/出願人 (米国についてののみ) 汲田 泉 (KUMITA, Izumi) [JP/JP] 岸本 孝 (KISHIMOTO, Takashi) [JP/JP] 柴田泰史 (SHIBATA, Yasushi) [JP/JP] 松田達彦 (MATSUDA, Michihiko) [JP/JP] 波多野達平 (HATANO, Renpei) [JP/JP] 岩佐孝男 (IWASA, Takao) [JP/JP] 〒250-02 神奈川県小田原市高田字柳町345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa, (JP) 野田 薫 (NODA, Kaoru) [JP/JP] 〒933 富山県高岡市向野本町300 日本曹達株式会社 高岡工場内 Toyama, (JP)</p>		<p>矢野真樹郎 (YANO, Makio) [JP/JP] 〒421-04 静岡県榛原郡榛原町坂部62-1 日本曹達株式会社 榛原農薬研究所内 Shizuoka, (JP) (74) 代理人 弁理士 東海裕作, 外 (TOKAI, Yusaku et al.) 〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 日本曹達株式会社内 Tokyo, (JP)  (81) 指定国 AT, AU, BB, BG, BR, CA, CH, CZ, DE, DK, ES, FI, GB, HU, JP, KR, LK, LU, MG, MN, MW, NL, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SK, UA, US, 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).  添付公開書類 国際調査報告書</p>

BEST AVAILABLE COPY

(54) Title : OXAZOLE AND THIAZOLE DERIVATIVES

(54) 発明の名称 オキサゾール及びチアゾール誘導体

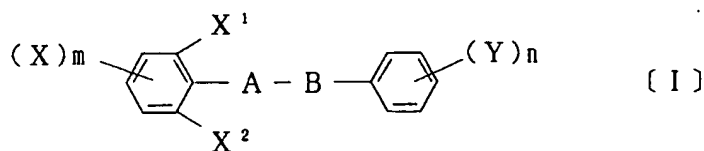


(57) Abstract

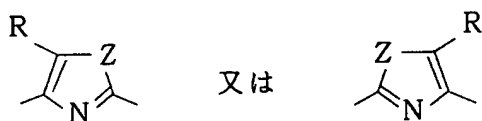
Compounds represented by general formula (I), a process for producing the same, and a pest control agent containing the same and having an excellent control effect particularly on cockroach and mite, wherein X<sup>1</sup> represents halogen, alkyl, alkoxy, alkylthio, etc.; X<sup>2</sup> represents hydrogen, halogen, alkyl, alkoxy, alkylthio, etc.; X represents halogen, alkyl, alkoxy, alkylthio, etc.; m represents 0 to 3; A represents (a) or (b) (wherein Z represents oxygen or sulfur, and R represents hydrogen, halogen, alkyl, etc.); B represents (c), (d), (e) or (f) (wherein R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> represent each hydrogen, halogen, alkyl, cycloalkyl, alkoxycarbonyl, alkylcarbamoyl, alkylthiocarbamoyl, phenylcarbamoyl, phenylthiocarbamoyl, -Q-r<sup>1</sup> or -SO<sub>2</sub>-r<sup>2</sup>, and D represents Cr<sup>4r5</sup>, oxygen or NOR<sup>6</sup>); and Y represents hydrogen, halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub> alkyl, etc.

# (57) 要約

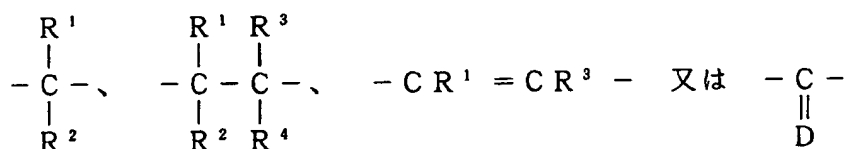
本発明は一般式〔I〕



〔X<sup>1</sup> はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、アルキルチオ基等、X<sup>2</sup> は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、アルキルチオ基等、X はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、アルキルチオ基等、m は 0 ~ 3、A は



〔Z は酸素原子、硫黄原子、R は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基等〕B は



〔R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、シクロアルキル基、アルコキシカルボニル基、アルキルカルバモイル基、アルキルチオカルバモイル基、フェニルカルバモイル基、フェニルチオカルバモイル基、-Q-r<sup>1</sup>、-SO<sub>2</sub>-r<sup>3</sup>、D は C r<sup>4</sup> r<sup>5</sup>、酸素原子、NO r<sup>6</sup>、Y は水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1-14</sub>アルキル基等〕で表される化合物、その製法および有害生物防除剤であり、特にアブラムシ、ダニに優れた防除効果を有する。

## 情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第1頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AT	オーストリア	CS	チェコスロヴァキア	KR	大韓民国	PL	ポーランド
AU	オーストラリア	CZ	チェッコ共和国	KZ	カザフスタン	PT	ポルトガル
BB	バルバドス	DE	ドイツ	LI	リヒテンシュタイン	RO	ルーマニア
BE	ベルギー	DK	デンマーク	LK	スリランカ	RU	ロシア連邦
BF	ブルキナファソ	ES	スペイン	LU	ルクセンブルグ	SD	スウェーデン
BG	ブルガリア	FI	フィンランド	LV	ラトヴィア	SE	スウェーデン
BJ	ベナン	FR	フランス	MC	モナコ	SI	スロヴェニア
BR	ブラジル	GA	ガボン	MG	マダガスカル	SK	スロヴァキア共和国
BY	ベラルーシ	GB	イギリス	ML	マリ	SN	セネガル
CA	カナダ	GN	ギニア	MN	モンゴル	TD	チャード
CF	中央アフリカ共和国	GR	ギリシャ	MR	モーリタニア	TG	トーゴ
CG	コンゴ	HU	ハンガリー	MW	マラウイ	UA	ウクライナ
CH	スイス	IE	アイルランド	NE	ニジェール	US	米国
CI	コートジボワール	IT	イタリア	NL	オランダ	UZ	ウズベキスタン共和国
CM	カメルーン	JP	日本	NO	ノルウェー	VN	ヴェトナム
CN	中国	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NZ	ニュージーランド		

## 明 細 書

## オキサゾール及びチアゾール誘導体

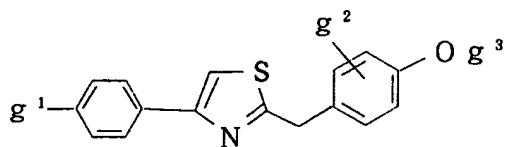
## 技術分野：

本発明は、新規なオキサゾール及びチアゾール誘導体、その製法及び有害生物防除剤に関する。

## 背景技術：

従来より、多数の殺虫剤、殺ダニ剤が使用されているが、その効力が不十分であったり、薬剤抵抗性問題によりその使用が制限されたり、また、植物体に薬害や汚染を生じたり、あるいは人畜魚類などに対する毒性が強かったりすることから、必ずしも満足すべき防除薬剤とは言い難いものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない安全に使用できる薬剤の開発が要望されている。

本発明化合物と類似した化合物を開示したものとしては次のようなものがある。USP 4, 153, 703には2, 4-ジフェニルチアゾール誘導体の殺虫・殺ダニ活性及びその製造法の記載がある。しかしながらその生物活性は実用的には不十分なものである。EP 420, 762には2-ベンジルオキサゾール、チアゾール誘導体

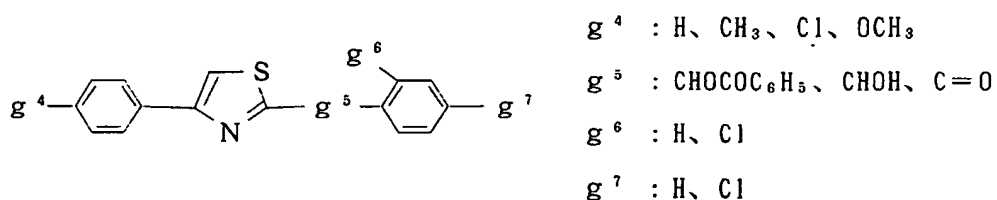


$g^1$  : H、CH<sub>3</sub>

$g^2$  : H、ハロゲン

$g^3$  : C<sub>4-6</sub> アルキル

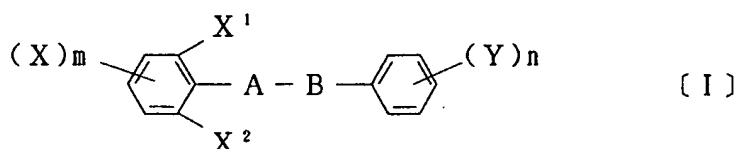
のリポキシゲナーゼ阻害作用について述べ医薬としての有用性が記載してあるが、農園芸作物を加害する病害虫の防除については何らの記載もない。また J. Indian Chem. Soc., Vol. LI, pp. 564 (1974) には次の化合物が記載されているが生物活性についての記載はない。



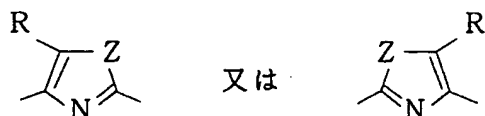
本発明の目的は、効果が確実で安全に使用できる有害生物防除剤を提供することである。

発明の開示：

本発明は一般式〔I〕

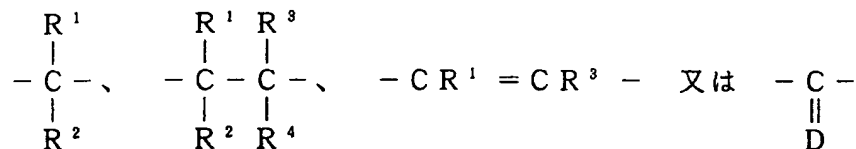


〔式中、X<sup>1</sup> はハロゲン原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルコキシ基、置換されていてもよい低級アルキルチオ基、置換されていてもよい低級アルコキシカルボニル基または置換されていてもよいアミノ基を表し、X<sup>2</sup> は水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルコキシ基、置換されていてもよい低級アルキルチオ基、置換されていてもよい低級アルコキシカルボニル基または置換されていてもよいアミノ基を表し、Xはハロゲン原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルコキシ基、置換されていてもよい低級アルキルチオ基、置換されていてもよい低級アルコキシカルボニル基または置換されていてもよいアミノ基を表し、mは0～3の整数を表し、Aは



〔式中、Zは酸素原子または硫黄原子を表し、Rは水素原子、アミノ基、アルコキシ基、ハロゲン原子、低級アルキル基またはフェニル基を表す。〕を表し、B

は



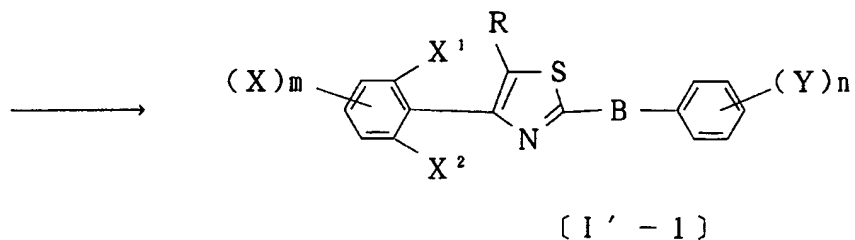
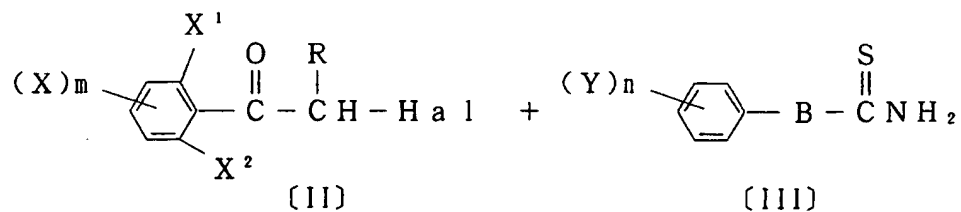
〔式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$  は同一又は相異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、シクロアルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルカルバモイル基、低級アルキルチオカルバモイル基、置換されていてもよいフェニルカルバモイル基、置換されていてもよいフェニルチオカルバモイル基、 $-\text{Q}-\text{r}^1$ 〔式中、 $\text{Q}$ は酸素原子、硫黄原子または $\text{N}\text{r}^2$ （ $\text{r}^2$ は水素原子または低級アルキル基を表す。）を表し、 $\text{r}^1$ は水素原子、シアノ基、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、シクロアルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルカルバモイル基、低級アルキルチオカルバモイル基、置換されていてもよいフェニルカルバモイル基、置換されていてもよいフェニルチオカルバモイル基または置換されていてもよい低級アルキルカルボニル基を表す。〕または $-\text{SO}_j-\text{r}^3$ 〔式中、 $j$ は1又は2を表し、 $\text{r}^3$ は置換されていてもよい低級アルキル基または置換されていてもよいフェニル基を表す。〕を表し、 $\text{D}$ は $\text{C}\text{r}^4\text{r}^5$ （ $\text{r}^4$ および $\text{r}^5$ は、それぞれ独立して水素、ハロゲン原子、置換されていてもよい低級アルキル基を表す。）、酸素原子または $\text{NO}\text{r}^6$ （ $\text{r}^6$ は水素原子、低級アルキル基、低級アルキルカルボニル基または低級アルキルカルバモイル基を表す。）を表し、 $\text{Y}$ は水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよい $\text{C}_{1-14}$ アルキル基、置換されていてもよい $\text{C}_{2-14}$ アルケニル基、置換されていてもよい $\text{C}_{2-14}$ アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキル基、 $\text{SO}_j\text{r}^7$ （式中、 $\text{r}^7$ は置換されていてもよい $\text{C}_{1-14}$ アルキル基、置換されていてもよい $\text{C}_{2-14}$ アルケニル基、置換されていてもよい $\text{C}_{2-14}$ アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキル基を表し、 $j$ は0、1または2を表す。）、 $\text{N}\text{r}^8\text{r}^9$ （式中、 $\text{r}^8$ および $\text{r}^9$ は、それぞれ独立して水素、置換されていてもよい $\text{C}_{1-14}$ アルキル基、置換されていて

もよい  $C_{2-14}$  アルケニル基、置換されていてもよい  $C_{2-14}$  アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルキル基を表す。) 、  $Or^{10}$  (式中、  $r^{10}$  は水素、置換されていてもよい  $C_{1-14}$  アルキル基、置換されていてもよい  $C_{2-14}$  アルケニル基、置換されていてもよい  $C_{2-14}$  アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルキル基、置換されていてもよいヘテロ環を表す。) 、  $Cor^{11}$  (式中、  $r^{11}$  は水素、置換されていてもよい  $C_{1-14}$  アルキル基、置換されていてもよい  $C_{2-14}$  アルケニル基、置換されていてもよい  $C_{2-14}$  アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルキル基を表す。) 、置換されていてもよいスルファモイル基または置換されていてもよいフェノキシ基を表し、または2つのYでS、OもしくはNを含んでもよく置換されていてもよい環を形成してもよく、nは0～5の整数を表す。) で表される化合物、その製法及び有害生物防除剤である。

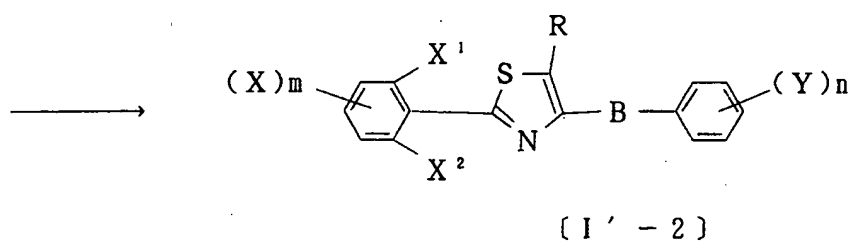
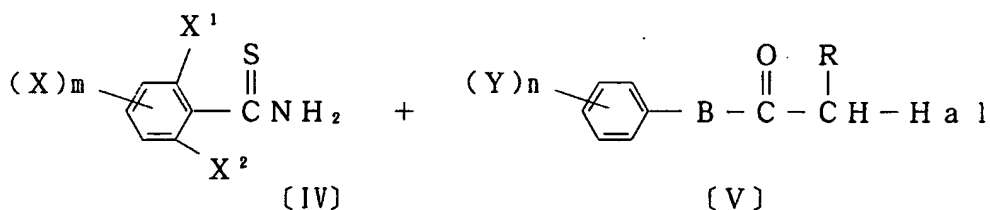
本発明において、アルキルを置換する基としては、例えばハロゲン原子、 $C_{3-8}$  シクロアルキル基、ヒドロキシ基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、低級アルコキシカルボニル基などが挙げられる。フェニルを置換する基としては例えばハロゲン原子、低級アルキル基などが挙げられる。ヘテロ環を置換する基としては例えばハロゲン原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい低級アルキル基などが挙げられる。スルファモイルを置換する基としては例えば低級アルキル基などが挙げられる。2つのYで形成する環を置換する基としては例えば低級アルキル基などが挙げられる。アミノを置換する基としては例えば低級アルキル基などが挙げられる。また通常、低級アルキル基の炭素数は1から6であり、シクロアルキル基の炭素数は3から8である。

本発明化合物の製法は、次の通りである。

(1-1)



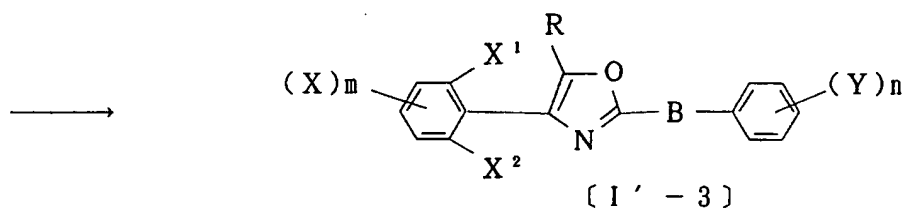
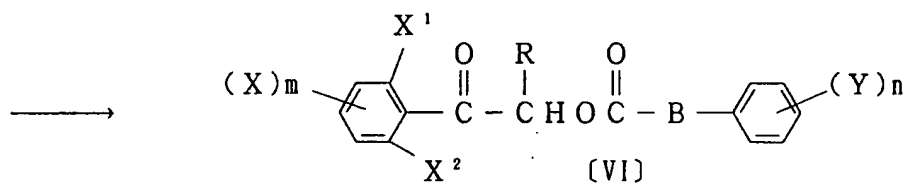
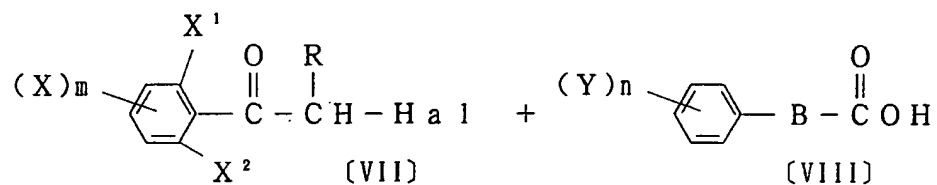
(1-2)



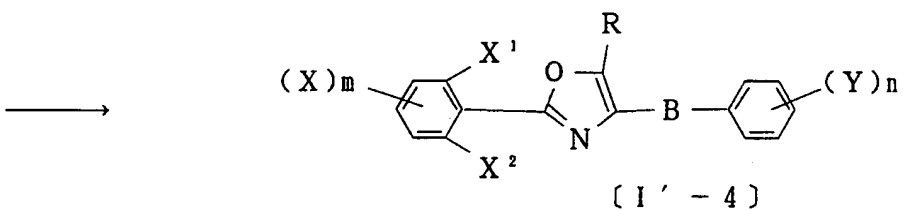
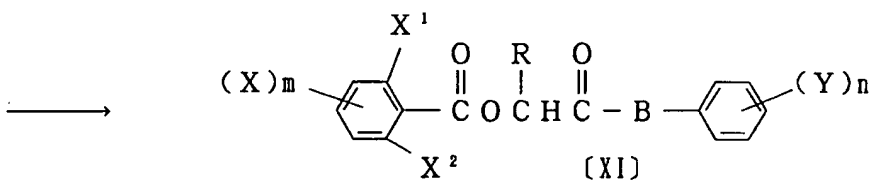
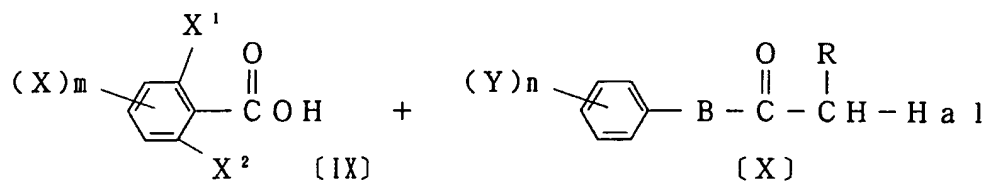
式中、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X$ 、 $m$ 、 $R$ 、 $B$ 、 $Y$ 、 $n$ 、 $Hal$ は前記と同じ意味を表す。  
 (1-1)、(1-2)の反応は、アルコール、DMF、アセトニトリル、DMSOあるいはクロロホルム、塩化メチレン等のハロゲン化炭化水素、ジオキサン等のエーテル類等の溶媒中で、場合によってはトリエチルアミン、ピリジン、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアニリン、DBUなどの有機塩基または水素化ナトリウム、炭酸カリ、炭酸ソーダ、水酸化ナトリウム等の無機塩基存在下、室温～200℃好ましくは60～180℃で反応させる。これと類似の合成方法についてはR. H

. WileyらがOrganic Reactions第6巻367ページ (John Wiley & Sons, Inc., New York 1951) に記載している。

(2-1)



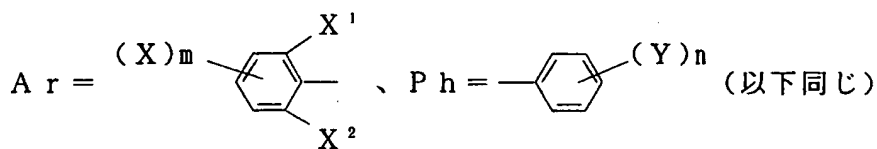
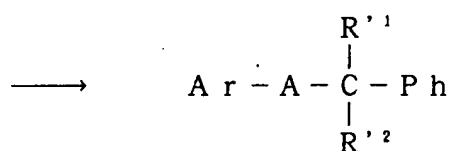
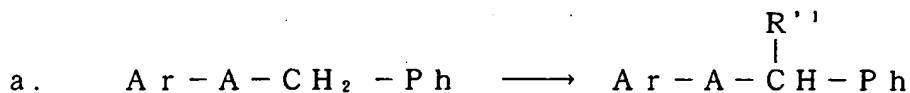
(2-2)



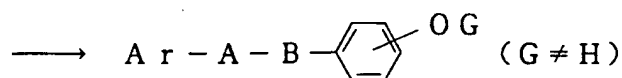
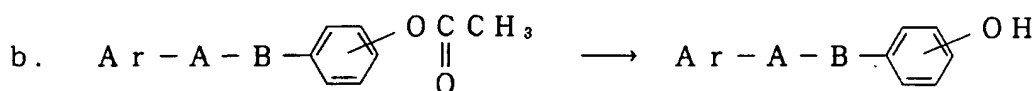


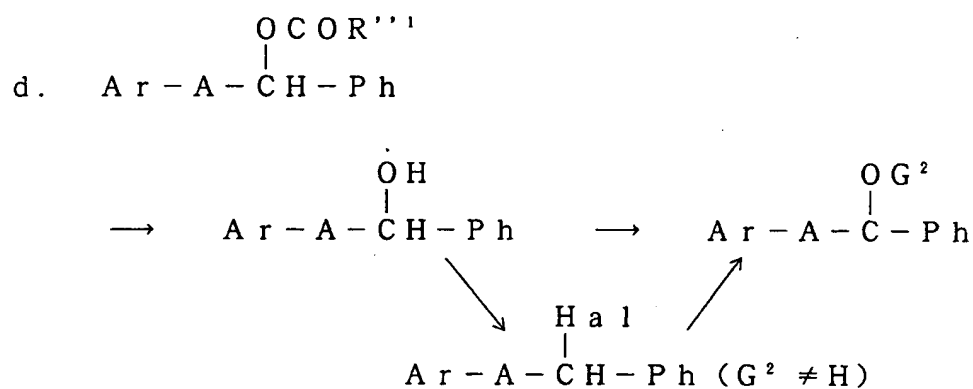
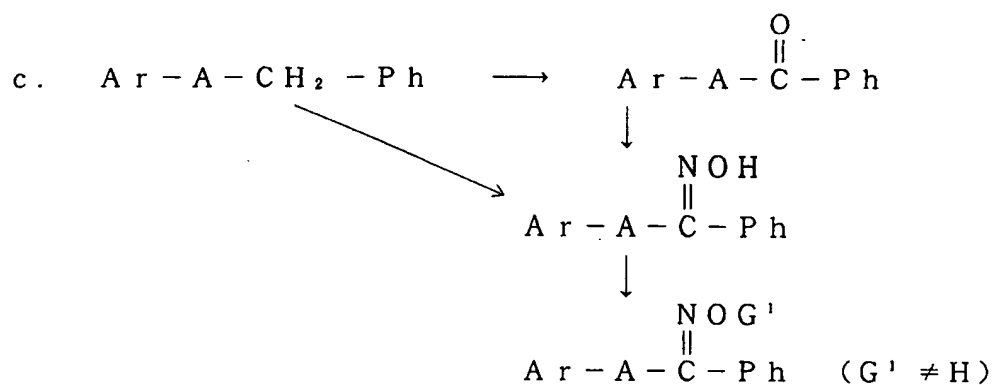
式中、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X$ 、 $m$ 、 $R$ 、 $B$ 、 $Y$ 、 $n$ 、 $Hal$ は前記と同じ意味を表す。  
 (2-1)、(2-2)の反応は、まず、〔VII〕と〔VIII〕、又は〔IX〕と〔X〕をアルコール、DMF、アセトニトリル、DMSOあるいはクロロホルム、塩化メチレン等のハロゲン化炭化水素、ジオキサン等のエーテル類等の溶媒中で、場合によってはトリエチルアミン、ピリジン、 $N,N$ -ジメチルアニリン、DBUなどの有機塩基または水素化ナトリウム、炭酸カリ、炭酸ソーダ、水酸化ナトリウム等の無機塩基存在下、室温～200℃好ましくは60～180℃で反応させることにより、ケトエステル誘導体〔VI〕または〔XI〕を得る。次にこのケトエステル誘導体と酢酸アンモニウム等のアンモニウム塩を有機溶媒中で室温から150℃好ましくは80～120℃で反応させる。これと類似の合成方法についてはR. LakhaniらがAdvances in Heterocyclic Chemistry 17巻99ページ(1974年)(Academic Press Inc. New York)に記載している。

さらに本発明化合物は、置換の種類によっては下記反応式あるいは公知と類似の反応を適宜選択することによっても製造することができる。



$R'^1$ 、 $R'^2$  = 低級アルキル基





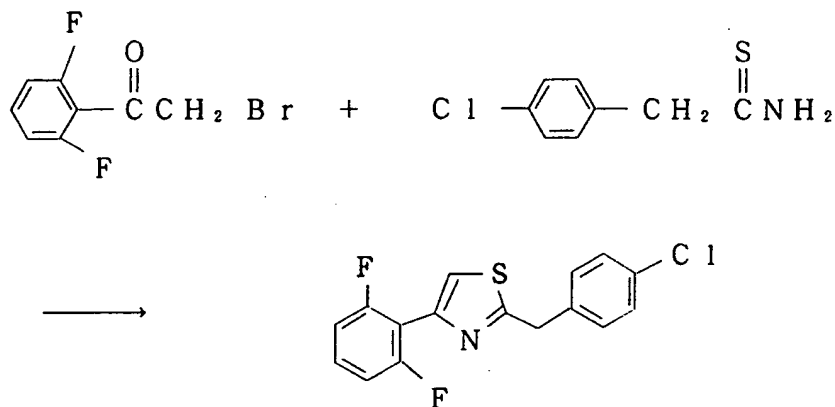
いずれの方法で反応を行った場合も反応終了後は通常の後処理を行うことにより目的物を得ることができる。

本発明化合物の構造は、IR、NMR、MS等から決定した。

発明を実施するための最良の形態：

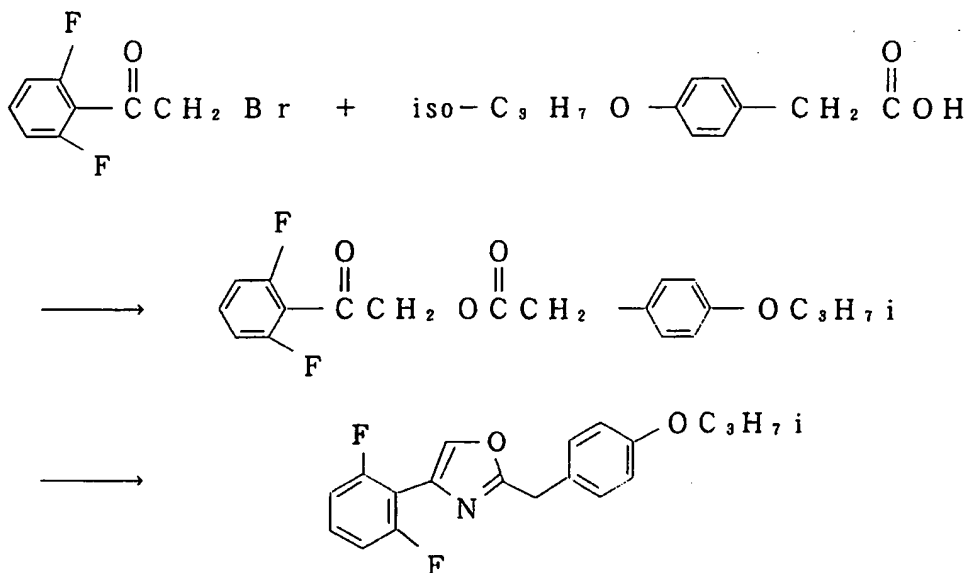
次に実施例を挙げ、本発明を更に詳しく説明する。

実施例 1 2-(4-クロロベンジル)-4-(2,6-ジフルオロフェニル)チアゾール(化合物番号41)の合成



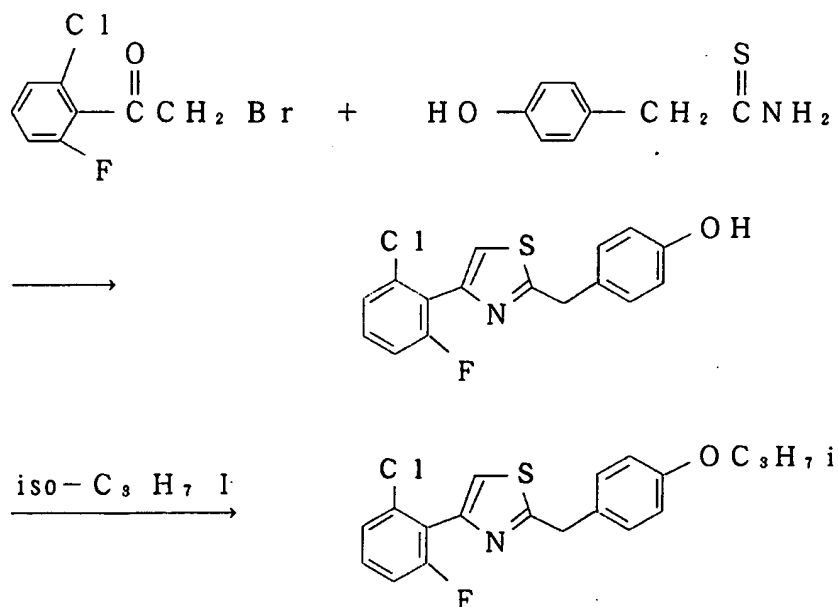
$\alpha$ -ブromo-2,6-ジフルオロアセトフェノン 1.3 g と 4-クロロベンジルチオアミド 1.0 g を 30 ml のエタノールに溶解し 2 時間還流反応させた。反応物を氷水中に注ぎクロロホルムで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後濃縮した。シリカゲルのカラムクロマトグラフィーで精製し、2-(4-クロロベンジル)-4-(2,6-ジフルオロフェニル)チアゾール 0.9 g を得た ( $n_D^{24}$  1.6038)。

実施例 2 4-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-(4-イソプロポキシベンジル)オキサゾール(化合物番号59)の合成



4-イソプロポキシフェニル酢酸 2 g を 30 ml の DMF に溶解し、60% NaOH 0.4 g を加え室温で 30 分間攪拌反応させた。 $\alpha$ -ブromo-2,6-ジフルオロアセトフェノン 2.4 g を 50°C を越えないように滴下した。その後 1 時間室温で反応させ反応物を氷水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、エステルを得た。このエステル 1.3 g を酢酸 30 ml に溶解し、酢酸アンモニウム 1.3 g を加え 100°C で 1 時間反応させた。反応物を氷水中に注ぎ酢酸エチルで抽出し、水洗後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮した。シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、4-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-(4-イソプロポキシベンジル)オキサゾール 0.38 g (mp. 40-41°C) を得た。

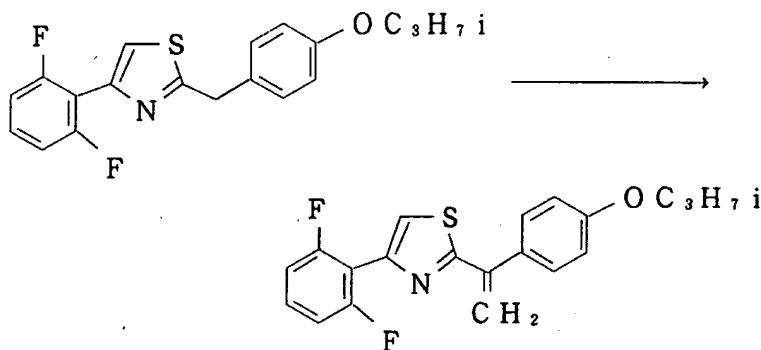
実施例 3 4-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2-(4-イソプロポキシベンジル)チアゾール (化合物番号 80) の合成



$\alpha$ -ブromo-2-クロロ-6-フルオロアセトフェノン 3.0 g と 4-ヒドロキシフェニルチオアセトアミド 2.0 g を 30 ml のエタノールに溶解し、2 時間還流反応させた。反応物を氷水中に注ぎクロロホルムで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後濃縮した。得られた結晶をクロロホルムで洗浄して、4-(2-クロ

ロロ-6-フルオロフェニル)-2-(4-ヒドロキシベンジル)チアゾール3.4 gを得た。このチアゾール0.7 gをDMF 30 mlに溶解し、水素化ナトリウム0.1 gを加えた。室温で1時間反応後ヨウ化イソプロピル0.5 gを滴下し、室温で2時間反応させた。反応終了後氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、乾燥濃縮後カラムクロマトグラフィーで精製し、4-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2-(4-イソプロポキシベンジル)チアゾール0.2 gを得た( $n_D^{25.0}$  1.5935)。

実施例4 4-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-[ $\alpha$ ,  $\alpha$ -メチリデン-(4-イソプロポキシ)ベンジル]チアゾール(化合物番号64)の合成



4-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-(4-イソプロポキシベンジル)チアゾール2 gをN, N-ジメチルホルムアミド20 mlに溶解し氷冷下、水素化ナトリウム(80%油性)0.25 gを加え、室温に戻し30分攪拌した。

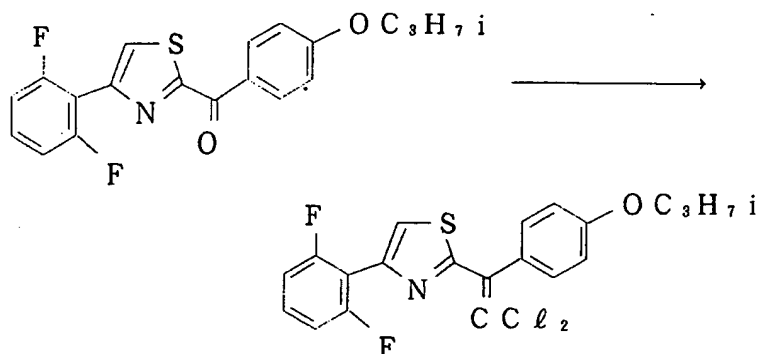
再び氷冷下、これにパラホルムアルデヒド0.35 gを加え、室温に戻し3時間、さらに50℃で1時間攪拌した。

反応液を氷水に注加し、酢酸エチルにて抽出、有機層を無水硫酸マグネシウム乾燥した後、減圧濃縮した。

得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで分離精製し、目的物0.5 gを得た( $n_D^{22.8}$  1.5849)。

実施例5 2-[ $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジクロロメチリデン-(4-イソプロポキシ)ベンジル]-4-(2,6-ジフルオロフェニル)チアゾール(化合物番号286

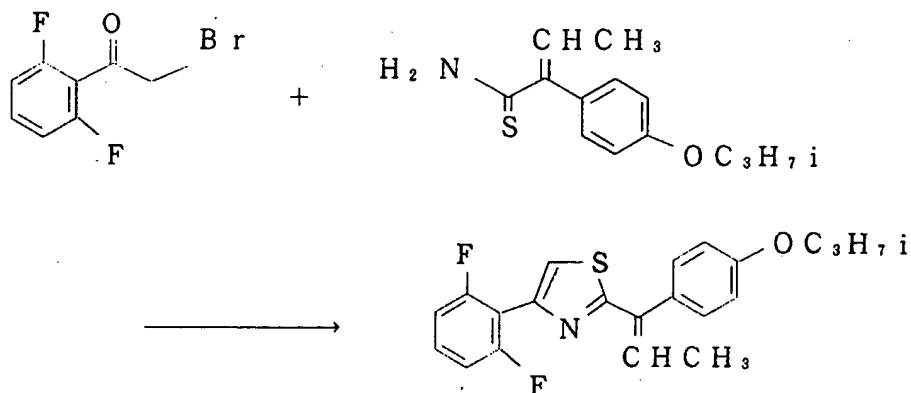
) の合成



4-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-(4-イソプロポキシベンゾイル)チアゾール 1 g とトリフェニルホスフィン 1.46 g を四塩化炭素 20 ml に溶解し、20 時間加熱還流した。

反応液を室温に戻した後、減圧濃縮し、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで分離精製して目的物 0.86 g ( $n_D^{20} 1.6201$ ) を得た。

実施例 6 4-(2,6-ジフルオロフェニル)-2- $\{\alpha, \alpha$ -エチリデン-(4-イソプロポキシベンジル) 〕チアゾール (化合物番号 285) の合成



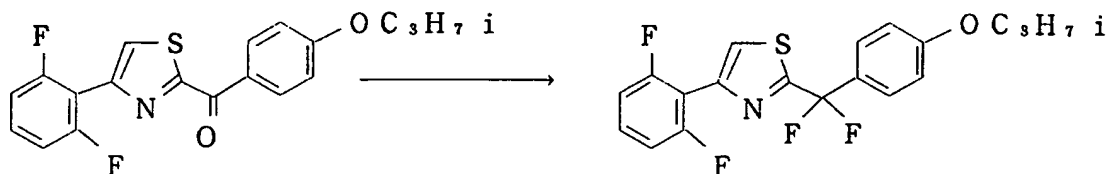
$\alpha$ -ブromo-2,6-ジフルオロアセトフェノン 1.2 g と 2,2-エチリデン-(4-イソプロポキシフェニル)アセトアミド 1.2 g をジオキサン 20 ml に溶解し、30 分加熱還流した。

反応液を室温に戻した後、酢酸エチルにて希釈し、これを水洗、有機層を無水

硫酸マグネシウムで乾燥した。

これを減圧濃縮して得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて分離精製し目的物 0.5 g ( $n_D^{25.5} 1.5963$ ) を得た。

実施例 7 2-( $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジフルオロ-4-イソプロポキシベンジル)-4-(2, 6-ジフルオロフェニル)チアゾール (化合物番号 281) の合成

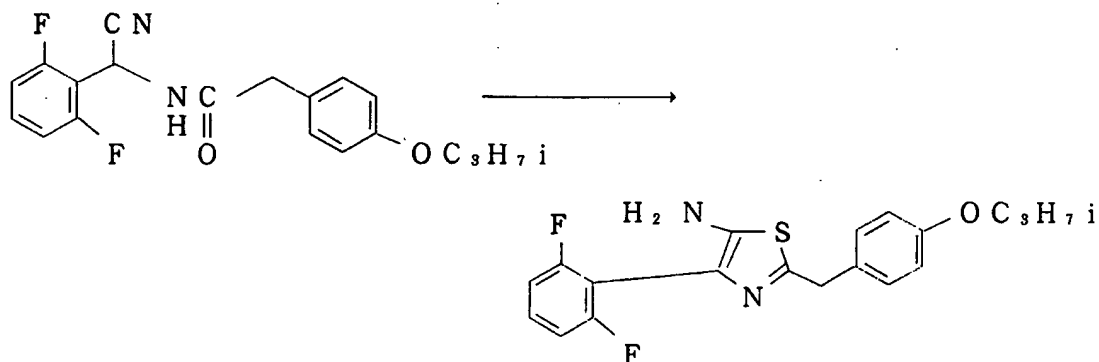


4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-2-(4-イソプロポキシベンゾイル)チアゾール 1 g とジエチルアミノスルファートリフルオライド (DAST) 2.2 ml の混合物を 60 °C で 9 時間攪拌した。

反応液に氷冷下で氷片および水を順次加え、酢酸エチルで抽出、有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。

これを減圧濃縮して得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて分離精製し、目的物 0.15 g ( $n_D^{22.2} 1.5532$ ) を得た。

実施例 8 5-アミノ-4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-2-(4-イソプロポキシベンジル)チアゾール (化合物番号 290) の合成



N-( $\alpha$ -シアノ-2, 6-ジフルオロベンジル)-4-イソプロポキシフェニルアセトアミド 1 g とローソン試薬 1.22 g をベンゼン 20 ml 溶解し、9

0 分加熱還流した。

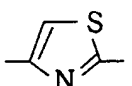
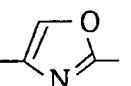
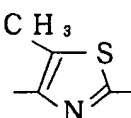
室温に戻した後、減圧濃縮して得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて分離精製し目的物 0.33 g を得た。(m p 109 – 111 °C)

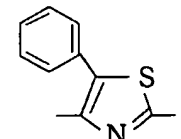
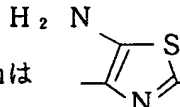
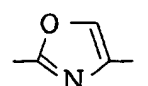
上記実施例を含め本発明化合物の代表例を第 1 表に示す。

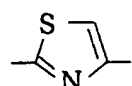


第 1 表

化合物番号	構造式							物理恒数
	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X	m	A*	B	(Y) <sub>n</sub>	
1	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>3</sub>	nD(25.0)1.5953
2	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> n	nD(25.0)1.5850
4	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(23.9)1.5819
5	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> C≡CH	nD(25.0)1.6040
6	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	nD(24.3)1.5972
7	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	nD(24.3)1.5786
8	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> i	
9	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> s	nD(24.5)1.5790
10	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
11	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> s	nD(25.0)1.5719
12	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	nD(25.0)1.5941
13	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	
14	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>11</sub> c	nD(23.6)1.5630
15	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	nD(21.9)1.5586
16	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> CH(Et)C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	nD(25.0)1.5580
17	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>10</sub> H <sub>21</sub> n	nD(23.6)1.5497
18	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>8</sub> H <sub>5</sub>	nD(23.4)1.5947
19	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p	
20	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -p	
21	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	[79-81]
22	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
23	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
24	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p	
25	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	nD(25.0)1.6205
26	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -p	
27	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub>	nD(24.0)1.5975

A\* : 表中、thiは 、oxaは 、Mthは 、

Pthは 、Athは 、xoxは 、

xthは  を表す。

第 1 表 ( 続 き )

28	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
29	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> n	
30	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
31	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	
32	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> s	
33	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> i	
34	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(23.9)1.5772
35	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	[59-60]
36	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
37	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
38	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
39	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
40	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> c	
41	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-Cl	nD(24.9)1.6038
42	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-Cl	nD(22.2)1.6069
43	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	nD(22.5)1.5483
44	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	nD(24.0)1.5370
45	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-F, 4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
46	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-Cl, 4-Cl	
47	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	nD(25.0)1.5928
48	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-Br	nD(23.1)1.6239
49	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3, 4-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	nD(24.5)1.6100
50	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
51	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-NHC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
52	Cl	H	3-Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(25.0)1.6118
53	Cl	H	4-Cl	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[39-40]
54	Cl	H		1	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[62-64]
55	F	F		0	thi	CO	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.5)1.6213
56	F	F		0	thi	CH(OH)	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[133-135]
57	F	F		0	Mth	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.1)1.5637
58	Cl	F		0	oxa	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.5)1.5614
59	F	F		0	oxa	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[40-41]
60	Cl	Cl		0	oxa	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.2)1.5774
61	Me	Me		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.7)1.5680
62	F	F		0	thi	CH(CH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.8)1.5722
63	F	F		0	thi	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(23.2)1.5545
64	F	F		0	thi	C(=CH <sub>2</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.8)1.5849
65	Cl	H	5-Cl	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(25.0)1.6182
66	Me	Me		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	nD(21.5)1.5914
67	F	F		0	thi	CH(Cl)	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[90-91]
68	F	F		0	thi	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.2)1.5636
69	OE <sub>t</sub>	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(28.5)1.5726
70	OE <sub>t</sub>	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	nD(22.3)1.5491
71	F	F		0	Pth	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[92-95]
72	Cl	Cl	3-CH <sub>3</sub>	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
73	Cl	Cl	4-CH <sub>3</sub>	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
74	Cl	Cl	4-CF <sub>3</sub>	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
75	Cl	Cl	3-OCH <sub>3</sub>	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
76	Cl	Cl	4-OCH <sub>3</sub>	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	

第 1 表 ( 続 き )

77	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>3</sub>	nD(25.0)1.5935
78	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
79	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7n</sub>	
80	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7i</sub>	
81	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> C≡CH	
82	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	nD(24.5)1.5880
83	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9n</sub>	
84	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9i</sub>	
85	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9s</sub>	
86	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9t</sub>	
87	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>5</sub> H <sub>11s</sub>	nD(28.6)1.5770
88	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9c</sub>	
89	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	
90	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>11c</sub>	
91	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>17</sub>	
92	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> CH(Et)C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	nD(21.9)1.5617
93	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>10</sub> H <sub>21n</sub>	
94	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
95	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p	
96	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -p	
97	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	nD(25.0)1.6100
98	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
99	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>3</sub> H <sub>7i</sub>	
100	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>3</sub> H <sub>9c</sub>	
101	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p	
102	Cl	F	0	thi	CH(OCH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>9c</sub>	nD(25.0)1.5929
103	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -p	
104	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub>	
105	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
106	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>3</sub> H <sub>7n</sub>	
107	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>3</sub> H <sub>7i</sub>	nD(26.0)1.5800
108	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9n</sub>	
109	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9s</sub>	
110	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9i</sub>	
111	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9t</sub>	
112	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	nD(23.7)1.5881
113	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
114	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
115	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-C <sub>4</sub> H <sub>9t</sub>	
116	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>3</sub> H <sub>7i</sub>	
117	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>11c</sub>	
118	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-Cl	
119	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-Cl	
120	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
121	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	
122	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	2-F, 4-OC <sub>3</sub> H <sub>7i</sub>	
123	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-Cl, 4-Cl	
124	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	

第1表 (続き)

125	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-Br	[56-58] nD(24.0)1.6271
126	Cl	F	0	thi	CH(NH <sub>2</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
127	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
128	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-NHC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
129	Cl	F	0	thi	CH(OCOCH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
130	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
131	Cl	F	0	thi	CH(OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
132	Cl	F	0	thi	C=NOH	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
133	Cl	F	0	thi	C=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
134	Cl	F	0	thi	C=NOCOCH <sub>3</sub>	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
135	Cl	F	0	thi	C=NOCONHCH <sub>3</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
136	Cl	F	0	thi	CH(OCOOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
137	Cl	F	0	thi	CH(OCOCH <sub>2</sub> Cl)	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	
138	Cl	F	0	thi	CH(SOCH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
139	Cl	F	0	thi	CH(SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )	4-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	
140	Cl	F	0	thi	CCH <sub>3</sub> (SCH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	nD(24.5)1.6210
141	Cl	F	0	thi	CH(NHCH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	
142	Cl	F	0	thi	CH(N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
143	Cl	F	0	thi	CH(OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	4-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	
144	Cl	F	0	thi	CH(SCN)	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
145	Cl	F	0	thi	CH <sub>2</sub>	3,4-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	
146	Cl	F	0	thi	CH(F)	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
147	Cl	F	0	thi	CH(SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p)	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
148	Cl	F	0	thi	CH(SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -p)	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
149	Cl	F	0	thi	CH(SC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p)	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	
150	Cl	F	0	thi	CH(NHC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p)	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
151	Cl	F	0	thi	CH(N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	
152	Cl	F	0	thi	CH(SCH <sub>3</sub> )	4-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	
153	Cl	F	0	thi	CH(OCONHCH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	
154	Cl	F	0	thi	CH(CSNHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	
155	Cl	F	0	thi	CH(CSNHC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p)	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
156	Cl	F	0	thi	CF <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
157	Cl	F	0	thi	C(=CCl <sub>2</sub> )	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
158	Cl	F	0	thi	C(=CHCH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
159	Cl	F	0	thi	CH(OH)	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
160	Cl	F	0	thi	CO	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
161	Cl	F	0	thi	CH(C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> c)	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
162	CH <sub>2</sub> Cl	H	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
163	CF <sub>3</sub>	H	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
164	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>3</sub>	
165	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
166	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> n	
167	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(21.7)1.6042
168	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> C≡CH	
169	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	
170	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	
171	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> i	
172	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> s	

第1表 (続き)

173	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(23.2)1.5988
174	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> s	
175	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
176	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	
177	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>11</sub> c	
178	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	
179	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> CH(Et)C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
180	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>10</sub> H <sub>21</sub> n	
181	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
182	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p	
183	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -p	
184	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
185	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
186	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
187	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p	
188	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
189	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -p	
190	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub>	
191	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
192	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> n	
193	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
194	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	nD(23.4)1.5925
195	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> s	
196	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> i	
197	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
198	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
199	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
200	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
201	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
202	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
203	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> c	
204	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-Cl	
205	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-Cl	
206	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
207	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	
208	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	2-F, 4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
209	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-Cl, 4-Cl	
210	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	
211	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-Br	nD(24.5)1.5928 [92-93] [105-108] nD(26.0)1.5690 アモルファス [58-59] [127.5-129]
212	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	3,4-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	
213	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
214	Cl	Cl	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-NHC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
215	OMe	OMe	0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
216	Cl	F	0	thi	CO	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
217	Cl	F	0	thi	CH(OH)	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
218	Cl	F	0	thi	CH(CH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
219	Cl	F	0	thi	COH(CH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
220	F	F	0	thi	CO	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
221	F	F	0	thi	CH(OH)	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	

第 1 表 ( 続 き )

222	F	F		0	thi	CH(CH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(20.8)1.5671
223	Cl	F		0	thi	CH(OH)	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[136-137]
224	Cl	F		0	thi	CH(CH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(20.7)1.5822
225	Cl	F		0	thi	COH(CH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.2)1.5818
226	Cl	F		0	thi	CO	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	[143-145]
227	Cl	F		0	thi	CH(OH)	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	[118-120]
228	Cl	F		0	thi	CH(CH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	nD(26.0)1.5457
229	Cl	F		0	thi	COH(CH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	nD(26.0)1.5758
230	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> c	nD(25.0)1.6000
231	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> c	nD(24.4)1.5887
232	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> c	
233	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C(=O)C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> c	
234	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	nD(24.2)1.6371
235	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p	
236	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	[96-97]
237	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
238	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p	
239	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
240	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-p	
241	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C(=O)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
242	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH(OH)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
243	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-Cl, 4-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
244	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-OEt, 4-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
245	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-F, 4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
246	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-Cl, 4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
247	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-OMe, 4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
248	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-OEt, 4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(21.5)1.5750
249	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> (C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	
250	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> (C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> n)	
251	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> (C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i)	
252	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH(CH <sub>3</sub> )(C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t)	
253	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-OMe, 4-Cl	nD(25.5)1.6176
254 <sup>*1</sup>	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3, 4-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> O-	nD(24.6)1.5945
255 <sup>*2</sup>	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3, 4-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	nD(24.5)1.5964
256	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-F, 4-OC <sub>5</sub> H <sub>9</sub> c	
257	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-SC <sub>6</sub> H <sub>9</sub> c	nD(22.2)1.6080
258	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(20.9)1.6177
259	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-SOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
260	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
261	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-NCH <sub>3</sub> (C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i)	nD(25.6)1.6112
262	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-Cl, 4-Cl, 5-Cl	
263	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-Cl, 4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t, 5-Cl	
264	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-OEt, 4-Cl, 5-Cl	
265	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	[90-91]
266	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-Cl, 4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(24.5)1.5920
267	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-OEt, 4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
268	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-Cl, 4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i, 5-Cl	
269	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3, 4-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> O-	
270	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3, 4-OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O-	nD(24.6)1.6162

第1表 (続き)

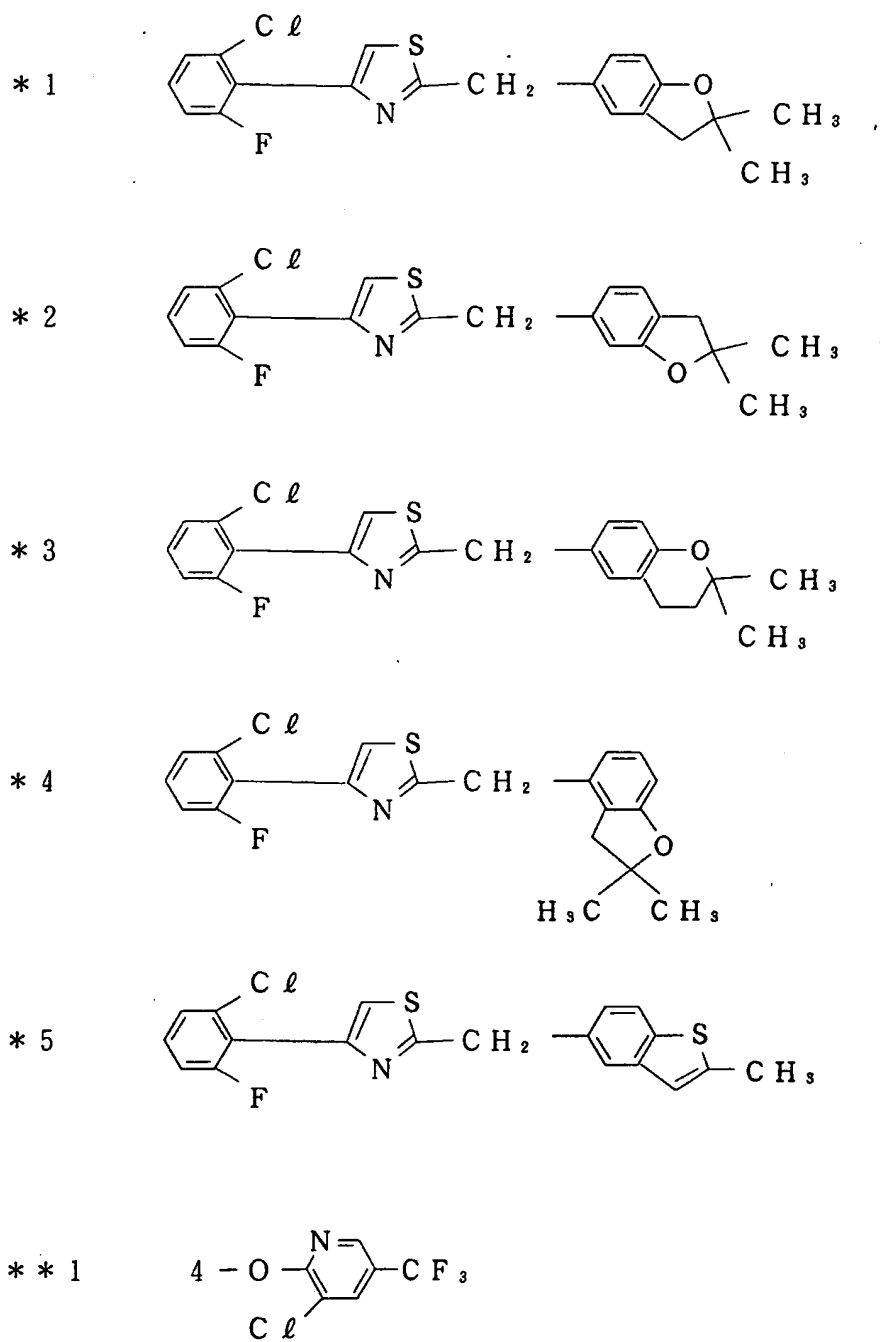
271*	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3, 4-C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> O-	nD(26.1)1.6032
272	F	F		0	xox	CO	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[79-81]
273	Me	Me		0	xth	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.8)1.5618
274	F	F		0	thi	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.2)1.5636
275	Cl	F		0	thi	CO	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(24.2)1.6229
276	F	F		0	thi	CH(OCH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.4)1.5805
277	F	F		0	thi	COH(CH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(23.2)1.5801
278	F	F		0	thi	CH(Cl)	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(23.2)1.5977
279	Cl	F		0	thi	CH(F)	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	[68-70]
280	Cl	F		0	thi	CH=CH	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(27.0)1.6537
281	F	F		0	thi	CF <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.2)1.5532
282	F	F		0	thi	CH(F)	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(23.4)1.5704
283	F	F		0	thi	C(=NOH)	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[116-120]
284	F	F		0	thi	C(=NOCH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(25.5)1.5978
285	F	F		0	thi	C(=CHCH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(25.5)1.5963
286	F	F		0	thi	C(=CCl <sub>2</sub> )	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(20.7)1.6201
287	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(23.8)1.5630
288	F	F		0	thi	CH=CH	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.0)1.5635
289	F	F		0	Pth	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[92-95]
290	F	F		0	Ath	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[109-111]
291	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	[94-96]
292	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(25.5)1.5788
293	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	nD(24.1)1.6300
294	Cl	F		0	thi	CO	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(24.2)1.6229
295	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	**1	アモルファス
296	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-SCH <sub>3</sub>	nD(24.5)1.6409
297	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	[116-117]
298	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> i	nD(24.5)1.5880
299	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(25.0)1.5929
300	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> n	nD(26.0)1.5800
301	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-Cl, 4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(24.0)1.5910
302	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	nD(25.0)1.6100
303	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-SOCH <sub>3</sub>	アモルファス
304	Cl	Cl	4-Cl	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(22.2)1.5795
305	F	F	4-F	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[79-80]
306	F	F	4-F	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(23.8)1.5565
307	F	F		0	xox	CH <sub>2</sub>	-(n=o)	nD(22.4)1.5728
308	F	F		0	xth	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(21.9)1.5614
309	Cl	Cl		0	xth	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(23.4)1.5890
310	F	F		0	thi	CH(CH <sub>3</sub> )	-(n=o)	nD(22.9)1.5919
311	F	F		0	thi	CO	2-F	[42-44]
312	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H		0	thi	CO	4-CF <sub>3</sub>	nD(23.0)1.5789
313	F	F		0	thi	CH=CH	-(n=o)	[67-69]
314	F	F		0	thi	CH=CH	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	[174-176]
315	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	[105-107]
316	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	-(n=o)	nD(22.5)1.6050
317	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-OH	[180-184]
318	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OCH <sub>3</sub>	nD(25.0)1.5881
319	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	2-Cl	nD(23.6)1.6060

第 1 表 ( 続 き )

320	OMe	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(22.2)1.5884
321	F	F		0	thi	COH(CH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(22.2)1.5699
322	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C(=O)CH <sub>3</sub>	nD(22.1)1.6069
323	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-CH(OH)CH <sub>3</sub>	nD(17.1)1.5887
324	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-CH <sub>2</sub> C(=CH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	nD(24.5)1.5759
							4-OEt	
325	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OEt	nD(23.0)1.5885
							4-CH <sub>2</sub> C(=CH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	
326	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	nD(23.5)1.5930
							4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	
327	F	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-COH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	nD(23.9)1.5935
328*4	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3,2-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	nD(24.0)1.5921
329	Cl	F		0	thi	CH(CO <sub>2</sub> Et)	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(22.5)1.5637
330	F	F		0	thi	CF(CH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(22.7)1.5603
331	F	F		0	thi	CCH <sub>3</sub> (OCH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	[ 71- 73 ]
332	Cl	F		0	thi	C(=CH <sub>2</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(23.4)1.5963
333	Cl	F		0	thi	C(=NOH)	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	[ 71- 73 ]
334	Cl	F		0	thi	CH(CH <sub>3</sub> )	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(22.6)1.5744
335	Cl	F		0	thi	CH(CSNHCH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	[ 56- 58 ]
336	Cl	F		0	thi	CH(OCOCH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	[ 77- 79 ]
337	Cl	F		0	thi	CH(OCOEt)	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	[ 76- 78 ]
338	Cl	F		0	thi	CH(OCSNHCH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	[ 53- 54 ]
339	Cl	F		0	thi	CF <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(26.1)1.5653
340	Cl	F		0	thi	CCH <sub>3</sub> (OCH <sub>3</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(24.7)1.5742
341	F	F		0	thi	COH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(27.0)1.5438
342*5	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3,4-C(H)=C(CH <sub>3</sub> )S-	nD(23.4)1.6135
343	F	F	3-F	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	nD(23.3)1.5639
344	F	F	3-F	1	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(23.7)1.5679
345	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t, 4-OEt	nD(22.5)1.5715
346	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-F, 4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(23.1)1.5554
347	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(23.5)1.5543
348	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3-OEt, 4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	nD(23.9)1.5483
349	Cl	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	3,5-F <sub>2</sub> , 4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	
350	-N-Me Me	F		0	thi	CH <sub>2</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	



第1表 (続き)



本発明化合物は農業上の有害生物、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫等の防除に使用でき、その代表例として、下記のもものが挙げられる。

鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ、ヨトウガ、タマナヤガ、アオムシ、タマナギンウワバ、コナガ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシンクイガ、ナシヒメシンクイ、ミカンハモグリガ、チャノホソガ、キンモンホソガ、マイマイガ、チャドクガ、ニカメイガ、コブノメイガ、ヨーロピアンコーンボラー、アメリカシロヒトリ、スジマダラメイガ、ヘリオティス属、ヘリコベルバ属、アグロティス属、イガ、コドリリング、ワタアカミムシ等、半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ、ニセダイコンアブラムシ、ムギクビレアブラムシ、ホソヘリカメムシ、アオクサカメムシ、ヤノネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、ナシキジラミ、ナシグンバイムシ、トビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、ツマグロヨコバイ等、鞘翅目害虫、例えば、キスジノミハムシ、ウリハムシ、コロラドハムシ、イネミズゾウムシ、コクゾウムシ、アゾキゾウムシ、マメコガネ、ヒメコガネ、ジアプロティカ属、タバコシバンムシ、ヒラタキクイムシ、マツノマダラカミキリ、ゴマダラカミキリ、アグリオティス属、ニジュウヤホシテントウ、コクヌスト、ワタミゾウムシ等、双翅目害虫、例えば、イエバエ、オオクロバエ、センチクバエ、ウリミバエ、ミカンコミバエ、タネバエ、イネハモグリバエ、キイロショウジョウバエ、サシバエ、コガタアカイエカ、ネッタイシマカ、シナハマダラカ等、総翅目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等、膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ、キイロスズメバチ、カブラハバチ等、直翅目害虫、例えば、チャバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、クロゴキブリ、トノサマバッタ等、等翅目害虫、例えば、イエシロアリ、ヤマトシロアリ等、隠翅目害虫、例えば、ヒトノミ等、シラミ目害虫、例えば、ヒトジラミ等、ダニ類、例えば、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リングハダニ、ミカンサビダニ、リングサビダニ、チャノホコリダニ、プレビパルバス属、エオテトラニカス属、ロビンネダニ、ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、オウシマダニ、フタトゲチマダニ等、植物寄生性線虫類、例えば、サツマイモネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、イネシン

ガレセンチュウ、マツノザイセンチュウ等。

又、近年コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシ等多くの害虫において有機リン剤、カーバメート剤に対する抵抗性が発達し、それら薬剤の効力不足問題を生じており、抵抗性系統の害虫にも有効な薬剤が望まれている。本発明化合物は感受性系統のみならず、有機リン剤、カーバメート剤、ピレスロイド剤、抵抗性系統の害虫にも優れた殺虫効果を有する薬剤である。

本発明の有害生物防除剤は、一般式〔I〕で表わされる化合物を有効成分として含有するものであり、有効成分化合物の純品のままでも使用できるが、通常、一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、水溶剤、粉剤、乳剤、粒剤、フロアブル等の形態で使用される。添加剤及び担体としては、固型剤を目的とする場合は、大豆粉、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石膏、タルク、ベントナイト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機および無機化合物が使用される。

液体の剤型を目的とする場合は、植物油、鉱物油、ケロシン、キシレンおよびソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トリクロルエチレン、メチルイソブチルケトン、水等を溶剤として使用する。これらの製剤において、均一なかつ安定な形態をとるために必要ならば界面活性剤を添加することもできる。このようにして得られた水和剤、乳剤、水溶液、フロアブル剤は水で所定の濃度に希釈して懸濁液あるいは乳濁液として、粉剤、粒剤はそのまま、植物に散布する方法で使用する。

なお、本発明化合物は単独でも十分有効であることはいうまでもないが、各種の殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤および共力剤と混合して使用することもできる。

本発明化合物と混合して使用できる殺虫剤や殺ダニ剤などの代表例を以下に示す。

有機燐およびカーバメート系殺虫剤：

フェンチオン、フェントロチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、E S P、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラソン、トリ

クロルホン、チオメトン、ホスメット、ジクロルボス、アセフェート、E P B P、メチルパラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、ホサロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロルビンホス、ジメチルビンホス、プロパホス、イソフェンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロボキスル、BPMC、MTMC、MIPC、カルバリル、ピリミカーブ、エチオフェンカルブ、フェノキシカルブ、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ等。

ピレスロイド系殺虫剤：

ベルメトリン、シベルメトリン、デルタメスリン、フェンバレレート、フェンプロパトリン、ピレトリン、アレスリン、テトラメスリン、レスメトリン、ジメスリン、プロパスリン、フェノトリン、プロトリン、フルバリネート、シフルトリン、シハロトリン、フルシトリネート、エトフェンプロクス、シクロプロトリン、トロラメトリン、シラフルオフエン、プロフェンプロクス、アクリナスリ等。

ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：

ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テフルベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェジン、ピリプロキシフェン、メトプレン、ベンゾエピン、ジアフェンチウロン、イミダクロプリド、フィプロニル、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、機械油、BTや昆虫病原ウイルスなどの微生物農薬等。

殺線虫剤：

フェナミホス、ホスチアゼート等。

殺ダニ剤：

クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、BPPS、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタスズ、ポリナクチン、キノメチオネート、CPCBS、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン

、クロフェンテジン、シヘキサチン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジエノクロル等。

**殺菌剤：**

チオファネートメチル、ベノミル、カルベンダゾール、チアベンダゾール、フォルペット、チウラム、ジラム、ジネブ、マンネブ、ポリカーバメート、IBP、EDDP、フサライド、プロベナゾール、イソプロチオラン、TPN、キャプタン、ポリオキシシ、プラストサイジンS、カスガマイシン、ストレプトマイシン、バリダマイシン、トリシクラゾール、ピロキロン、フェナジンオキシド、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、イプロジオン、ヒメキサゾール、メタラキシル、トリフルミゾール、トリホリン、トリアジメホン、ビテルタノール、フェナリモル、プロピコナゾール、シモキサニル、プロクロラズ、ペフラゾエート、ヘキサコナゾール、ミクロブタニル、ジクロメジン、テクロフタラム、プロピネブ、ジチアノン、ホセチル、ピンクロゾリン、プロシミドン、オキサジキシル、グアザチン、プロパモカルブ塩酸塩、フルアジナム、オキシソリニック酸、ヒドロキシイソキサゾール等。

次に製剤の実施例を示すが、添加する担体、界面活性剤等はこれらの実施例に限定されるものではない。

**実施例 9 乳剤**

本発明化合物	10部
アルキルフェニルポリオキシエチレン	5部
ジメチルホルムアミド	50部
キシレン	35部

以上を混合溶解し、使用に際し水で希釈して乳濁液として散布する。

**実施例 10 水和剤**

本発明化合物	10部
高級アルコール硫酸エステル	5部
珪藻土	80部
シリカ	5部

以上を混合して微粉に粉碎し、使用に際し水で希釈して懸濁液として散布する

。

## 実施例 1 1 粉剤

本発明化合物	5 部
タルク	9 4 . 7 部
シリカ	0 . 3 部

以上を混合粉碎し、使用に際してはそのまま散布する。

## 実施例 1 2 粒剤

本発明化合物	5 部
クレー	7 3 部
ベントナイト	2 0 部
ジオクチルスルホサクシネートナトリウム塩	1 部
リン酸ナトリウム	1 部

以上を造粒し、使用に際してはそのまま施用する。

## 産業上の利用可能性：

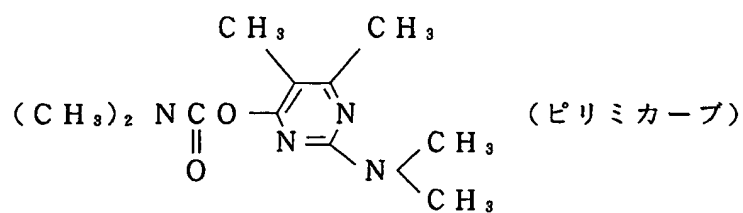
## 試験例 1 ワタアブラムシに対する効力

3 寸鉢に播種した発芽後 1 0 日が経過したキュウリにワタアブラムシ成虫を接種した。1 日後に成虫を除去し、産下された若虫が寄生するキュウリに、前記薬剤の実施例 9 に示された乳剤の処方に従い、化合物濃度が 1 2 5 p p m になるように水で希釈した薬液を散布した。温度 2 5 ℃、湿度 6 5 % の恒温室内に置き、6 日後に殺虫率を調査した。結果を第 2 表に示した。

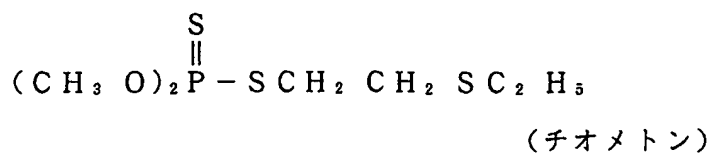
第 2 表

化合物番号	6日後殺虫率(%)
1	9 0
2 7	1 0 0
4 1	1 0 0
4 3	1 0 0
4 4	1 0 0
4 8	1 0 0
5 9	1 0 0
1 1 1	1 0 0
1 9 7	9 2
2 1 6	1 0 0
2 1 8	1 0 0
2 2 0	1 0 0
2 5 3	1 0 0
2 5 8	1 0 0
2 8 4	1 0 0
2 9 9	1 0 0
3 2 0	1 0 0
3 3 2	1 0 0
3 3 6	9 6
对照化合物 A	6
对照化合物 B	1 0 0

对照化合物 A



对照化合物 B



## 試験例 2 ナミハダニに対する効力

2 寸鉢に播種したインゲンの発芽後 7 ～ 1 0 日を経過した第 1 本葉上に、有機  
燐剤抵抗性のナミハダニの雌成虫を 1 7 頭接種したのち、前記薬剤の実施例 1 0  
に示された水和剤の処方に従がい、化合物濃度が 1 2 5 p p m になるように水で  
希釈した薬液を散布した。温度 2 5 ℃、湿度 6 5 % の恒温室内に置き、散布 3 日  
後に、成虫を除去し、この 3 日間に産付された卵に関し、成虫まで発育し得たか  
否かを 1 1 日目に調査し、殺ダニ有効度を求めた。結果を第 3 表に示した。なお  
、殺ダニ有効度は、次式により求めた。

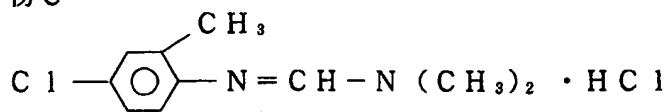
$$\text{殺ダニ有効度 (\%)} = \frac{\text{無処理区成虫数} - \text{処理区成虫数}}{\text{無処理区成虫数}} \times 100$$



第 3 表

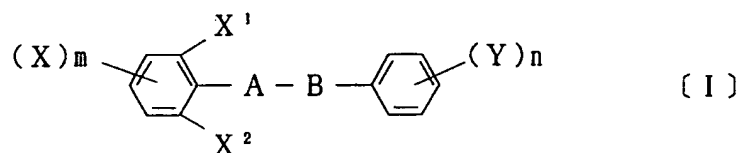
化合物番号	殺ダニ有効度 (%)	化合物番号	殺ダニ有効度 (%)
3	97	231	92
4	100	236	100
6	95	248	99
7	99	254	100
11	100	261	100
12	100	265	96
14	100	266	83
15	100	271	100
16	100	275	100
17	84	276	100
18	94	277	100
34	100	278	100
43	91	281	100
44	98	282	100
48	84	283	100
52	90	284	88
55	100	285	100
56	100	286	95
80	100	288	100
86	100	291	83
88	100	294	100
91	99	295	100
94	100	296	96
111	100	298	100
128	100	299	100
215	91	300	97
216	100	301	100
217	100	302	100
218	100	305	100
219	100	306	100
220	100	320	100
221	100	321	99
222	84	329	99
223	100	332	100
224	100	333	100
225	100	334	99
226	100	335	100
227	100	336	98
228	100	337	100
229	100	338	100
230	100	342	97
対照化合物 C		55	

対照化合物 C

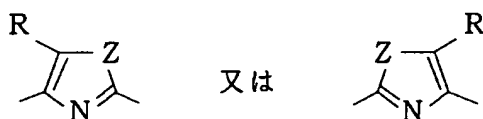


## 請 求 の 範 囲

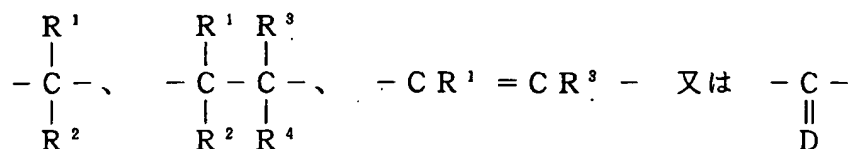
## 1. 一般式〔I〕



〔式中、 $\text{X}^1$  はハロゲン原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルコキシ基、置換されていてもよい低級アルキルチオ基、置換されていてもよい低級アルコキシカルボニル基または置換されていてもよいアミノ基を表し、 $\text{X}^2$  は水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルコキシ基、置換されていてもよい低級アルキルチオ基、置換されていてもよい低級アルコキシカルボニル基または置換されていてもよいアミノ基を表し、 $\text{X}$  はハロゲン原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルコキシ基、置換されていてもよい低級アルキルチオ基、置換されていてもよい低級アルコキシカルボニル基または置換されていてもよいアミノ基を表し、 $m$  は 0 ～ 3 の整数を表し、 $A$  は



〔式中、 $Z$  は酸素原子または硫黄原子を表し、 $R$  は水素原子、アミノ基、アルコキシ基、ハロゲン原子、低級アルキル基またはフェニル基を表す。〕を表し、 $B$  は

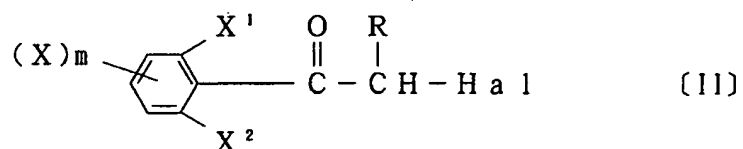


〔式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$  は同一又は相異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、シクロアルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルカルバモイル基、低級アルキルチオカルバモイル基、置換されていてもよい

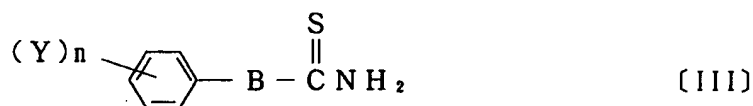
フェニルカルバモイル基、置換されていてもよいフェニルチオカルバモイル基、  
 $-Q-r^1$  [式中、Qは酸素原子、硫黄原子または $Nr^2$  ( $r^2$ は水素原子または低級アルキル基を表す。)]を表し、 $r^1$ は水素原子、シアノ基、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、シクロアルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルカルバモイル基、低級アルキルチオカルバモイル基、置換されていてもよいフェニルカルバモイル基、置換されていてもよいフェニルチオカルバモイル基または置換されていてもよい低級アルキルカルボニル基を表す。] または $-SO_i-r^3$  [式中、iは1又は2を表し、 $r^3$ は置換されていてもよい低級アルキル基または置換されていてもよいフェニル基を表す。]を表し、Dは $Cr^4r^5$  ( $r^4$ および $r^5$ は、それぞれ独立して水素、ハロゲン原子、置換されていてもよい低級アルキル基を表す。)、酸素原子または $NO r^6$  ( $r^6$ は水素原子、低級アルキル基、低級アルキルカルボニル基または低級アルキルカルバモイル基を表す。)]を表し、Yは水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよい $C_{1-14}$ アルキル基、置換されていてもよい $C_{2-14}$ アルケニル基、置換されていてもよい $C_{2-14}$ アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキル基、 $SO_jr^7$  (式中、 $r^7$ は置換されていてもよい $C_{1-14}$ アルキル基、置換されていてもよい $C_{2-14}$ アルケニル基、置換されていてもよい $C_{2-14}$ アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキル基を表し、jは0、1または2を表す。)、 $Nr^8r^9$  (式中、 $r^8$ および $r^9$ は、それぞれ独立して水素、置換されていてもよい $C_{1-14}$ アルキル基、置換されていてもよい $C_{2-14}$ アルケニル基、置換されていてもよい $C_{2-14}$ アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキル基を表す。)、 $Or^{10}$  (式中、 $r^{10}$ は水素、置換されていてもよい $C_{1-14}$ アルキル基、置換されていてもよい $C_{2-14}$ アルケニル基、置換されていてもよい $C_{2-14}$ アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキル基、置換されていてもよいヘテロ環を表す。)、 $CO r^{11}$  (式中、 $r^{11}$ は水素、置換されていてもよい $C_{1-14}$ アルキル基、置換されていてもよい $C_{2-14}$ アルケニル基、置換されていてもよい $C_{2-14}$ アルキニル基、置換されていてもよい

いフェニル基、置換されていてもよい $C_3-8$ シクロアルキル基を表す。)、置換されていてもよいスルファモイル基または置換されていてもよいフェノキシ基を表し、または2つのYでS、OもしくはNを含んでもよく置換されていてもよい環を形成してもよく、nは0～5の整数を表す。)で表される化合物。

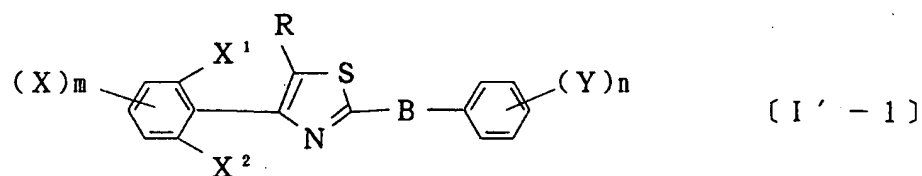
## 2. 一般式〔II〕



〔式中、 $X^1$ 、 $X^2$ 、X、m、Rは前記と同じ意味を表し、Halはハロゲン原子を表す。〕で表される化合物と、一般式〔III〕

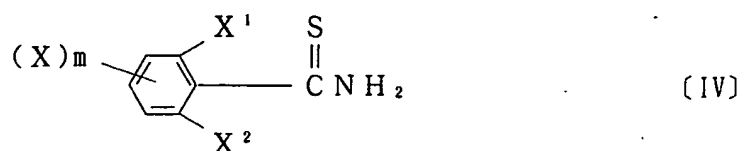


〔式中、B、Y、nは前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物を反応させることを特徴とする一般式〔I' - 1〕

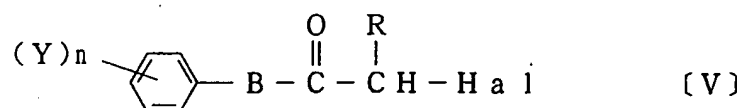


〔式中、 $X^1$ 、 $X^2$ 、X、m、R、B、Y、nは前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物の製造方法。

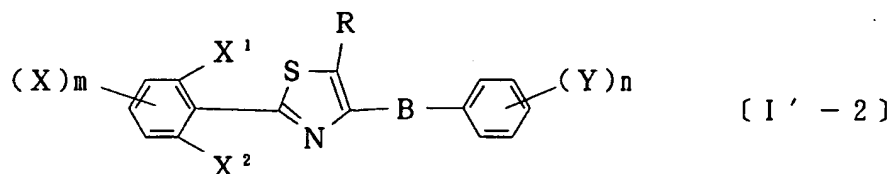
## 3. 一般式〔IV〕



〔式中、 $\text{X}^1$ 、 $\text{X}^2$ 、 $\text{X}$ 、 $m$ は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物と、一般式〔V〕

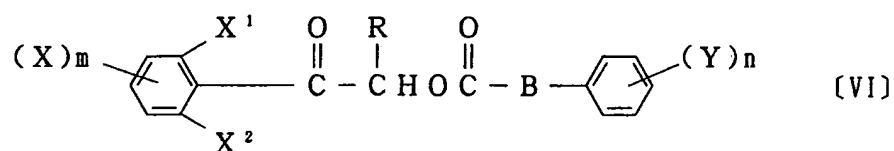


〔式中、 $\text{B}$ 、 $\text{Y}$ 、 $n$ 、 $\text{R}$ 、 $\text{Hal}$ は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物を反応させることを特徴とする一般式〔I' - 2〕

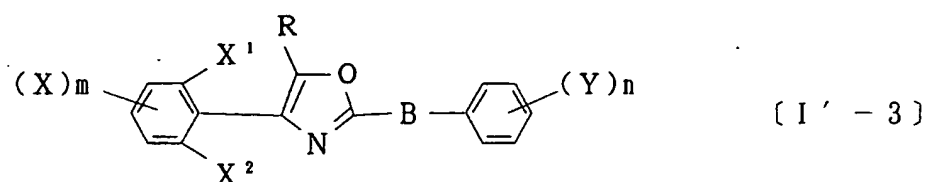


〔式中、 $\text{X}^1$ 、 $\text{X}^2$ 、 $\text{X}$ 、 $m$ 、 $\text{R}$ 、 $\text{B}$ 、 $\text{Y}$ 、 $n$ は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物の製造方法。

## 4. 一般式〔VI〕

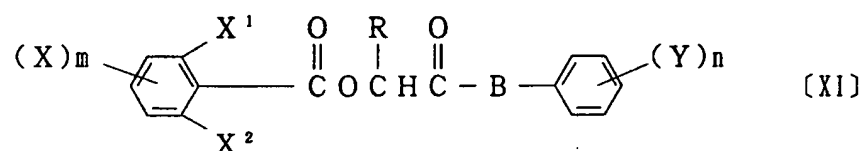


〔式中、 $\text{X}^1$ 、 $\text{X}^2$ 、 $\text{X}$ 、 $m$ 、 $\text{R}$ 、 $\text{B}$ 、 $\text{Y}$ 、 $n$ は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物をアンモニウム塩と反応、閉環することを特徴とする一般式〔I' - 3〕

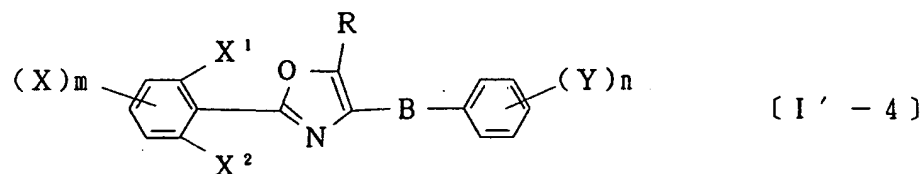


〔式中、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X$ 、 $m$ 、 $R$ 、 $B$ 、 $Y$ 、 $n$ は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物の製造方法。

### 5. 一般式〔VII〕

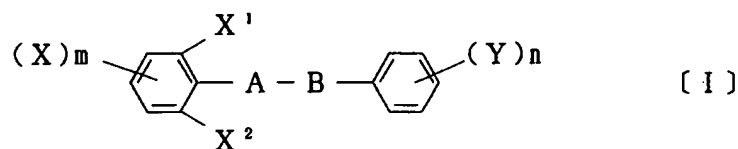


〔式中、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X$ 、 $m$ 、 $R$ 、 $B$ 、 $Y$ 、 $n$ は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物をアンモニウム塩と反応、閉環することを特徴とする一般式〔I' - 4〕



〔式中、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X$ 、 $m$ 、 $R$ 、 $B$ 、 $Y$ 、 $n$ は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物の製造方法。

### 6. 一般式〔I〕



〔式中、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X$ 、 $m$ 、 $A$ 、 $B$ 、 $Y$ および $n$ は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物の1種または2種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP93/01459

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl<sup>5</sup> C07D263/32, 263/34, 277/22, 277/24, 413/06, 417/10,  
A01N43/76, 43/78  
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl<sup>5</sup> C07D263/32, 263/34, 277/22, 277/24, 413/06, 417/10,  
A01N43/76, 43/78

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP, A, 3-101669 (Roussl Huchaf), April 26, 1991 (26. 04. 91), & EP, A, 402246 & FR, A, 2647787	1, 6
X	JP, A, 2-180866 (BASF AG.), July 13, 1990 (13. 07. 90), & EP, A, 378755 & US, A, 5250553	1, 6
Y	JP, A, 61-180778 (Shell Internationale Research Maatschappij N.V.), August 13, 1986 (13. 08. 86), & EP, A, 189960 & US, A, 5166216	1, 6
A	JP, A, 3-81268 (Shell Internationale Research Maatschappij N.V.), April 5, 1991 (05. 04. 91), & EP, A, 411718	1, 6

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

## \* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date  
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
December 3, 1993 (03. 12. 93)

Date of mailing of the international search report  
December 21, 1993 (21. 12. 93)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office  
Facsimile No.

Authorized officer  
  
Telephone No.

<p>A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))</p> <p>Int. Cl.<sup>8</sup> C07D263/32, 263/34, 277/22, 277/24, 413/06, 417/10, A01N43/76, 43/78</p>																	
<p>B. 調査を行った分野</p> <p>調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))</p> <p>Int. Cl.<sup>8</sup> C07D263/32, 263/34, 277/22, 277/24, 413/06, 417/10, A01N43/76, 43/78</p> <p>最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの</p> <p>国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)</p>																	
<p>C. 関連すると認められる文献</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th>引用文献の カテゴリー*</th> <th>引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示</th> <th>関連する 請求の範囲の番号</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>X</td> <td>JP, A. 3-101669 (ルセルー ユクラフ), 26. 4月. 1991 (26. 04. 91) &amp;EP, A. 402246 &amp; FR, A. 2647787</td> <td>1. 6</td> </tr> <tr> <td>X</td> <td>JP, A. 2-180866 (ビーエーエスエフ アクチエンゲゼルシャフト), 13. 7月. 1990 (13. 07. 90) &amp;EP, A. 378755 &amp; US, A. 5250553</td> <td>1. 6</td> </tr> </tbody> </table> <p><input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。</p> <p>* 引用文献のカテゴリー  「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの  「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの  「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)  「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献  「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献  「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの  「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの  「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの  「&amp;」 同一パテントファミリー文献</p> <table border="1"> <tr> <td> <p>国際調査を完了した日</p> <p>03. 12. 93</p> </td> <td> <p>国際調査報告の発送日</p> <p>21. 12. 93</p> </td> </tr> <tr> <td> <p>名称及びあて先</p> <p>日本国特許庁 (ISA/JP)</p> <p>郵便番号 100</p> <p>東京都千代田区霞が関三丁目4番3号</p> </td> <td> <table border="1"> <tr> <td> <p>特許庁審査官 (権限のある職員)</p> <p>大宅 郁 治</p> <p>電話番号 03-3581-1101 内線 3453</p> </td> <td> <p>4 C 9 2 8 3</p> </td> </tr> </table> </td> </tr> </table>			引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号	X	JP, A. 3-101669 (ルセルー ユクラフ), 26. 4月. 1991 (26. 04. 91) &EP, A. 402246 & FR, A. 2647787	1. 6	X	JP, A. 2-180866 (ビーエーエスエフ アクチエンゲゼルシャフト), 13. 7月. 1990 (13. 07. 90) &EP, A. 378755 & US, A. 5250553	1. 6	<p>国際調査を完了した日</p> <p>03. 12. 93</p>	<p>国際調査報告の発送日</p> <p>21. 12. 93</p>	<p>名称及びあて先</p> <p>日本国特許庁 (ISA/JP)</p> <p>郵便番号 100</p> <p>東京都千代田区霞が関三丁目4番3号</p>	<table border="1"> <tr> <td> <p>特許庁審査官 (権限のある職員)</p> <p>大宅 郁 治</p> <p>電話番号 03-3581-1101 内線 3453</p> </td> <td> <p>4 C 9 2 8 3</p> </td> </tr> </table>	<p>特許庁審査官 (権限のある職員)</p> <p>大宅 郁 治</p> <p>電話番号 03-3581-1101 内線 3453</p>	<p>4 C 9 2 8 3</p>
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号															
X	JP, A. 3-101669 (ルセルー ユクラフ), 26. 4月. 1991 (26. 04. 91) &EP, A. 402246 & FR, A. 2647787	1. 6															
X	JP, A. 2-180866 (ビーエーエスエフ アクチエンゲゼルシャフト), 13. 7月. 1990 (13. 07. 90) &EP, A. 378755 & US, A. 5250553	1. 6															
<p>国際調査を完了した日</p> <p>03. 12. 93</p>	<p>国際調査報告の発送日</p> <p>21. 12. 93</p>																
<p>名称及びあて先</p> <p>日本国特許庁 (ISA/JP)</p> <p>郵便番号 100</p> <p>東京都千代田区霞が関三丁目4番3号</p>	<table border="1"> <tr> <td> <p>特許庁審査官 (権限のある職員)</p> <p>大宅 郁 治</p> <p>電話番号 03-3581-1101 内線 3453</p> </td> <td> <p>4 C 9 2 8 3</p> </td> </tr> </table>	<p>特許庁審査官 (権限のある職員)</p> <p>大宅 郁 治</p> <p>電話番号 03-3581-1101 内線 3453</p>	<p>4 C 9 2 8 3</p>														
<p>特許庁審査官 (権限のある職員)</p> <p>大宅 郁 治</p> <p>電話番号 03-3581-1101 内線 3453</p>	<p>4 C 9 2 8 3</p>																



C (続き). 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	JP, A, 61-180778 (シエル・インターナショナル リサーチ・マーチャッピイ・ペー・ウィ), 13. 8月, 1986 (13. 08. 86) &EP, A, 189960&US, A, 5166216	1, 6
A	JP, A, 3-81268 (シエル・インターナショナル リサーチ・マーチャッピイ・ペー・ウィ), 5. 4月, 1991 (05. 04. 91) &EP, A, 411718	1-6

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**